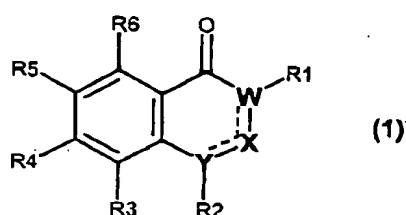


- 35 -

Ansprüche**1. Verbindungen der allgemeinen Formel (1):**

worin

- R¹** (a) eine Acylgruppe $-\text{CO}-\text{R}_{11}$ oder CN ist, wobei R_{11} ein gesättigter, ungesättigter, cyclischer oder/und (hetero)aromatischer organischer Rest, insbesondere eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1 - 10 C-Atomen, oder eine ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierte Phenyl-, Furan- oder Thiophengruppe ist,
- (b) eine Carbonsäureestergruppe $-\text{CO}-\text{OR}_{12}$ oder Carbonsäuramid-gruppe $-\text{CO}-\text{NR}_{12}\text{R}_{13}$ oder eine Gruppe $-\text{SO}_x-\text{R}_{12}$ mit $x = 0, 1$ oder 2 oder $-\text{SO}_2-\text{NR}_{12}\text{R}_{13}$ ist, wobei R_{12} ein gesättigter, ungesättigter, cyclischer oder/und (hetero)aromatischer organischer Rest, insbesondere eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen, eine Alkylgruppe mit 7-20 C-Atomen, wobei der Arylrest ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituiert sein kann, oder ein ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierter Phenylrest ist und R_{13} ein Wasserstoffatom

- 36 -

oder eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen sein kann,

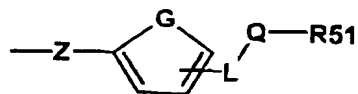
oder

(c) die Gruppe -A-NR₁₄-CO-NR₁₅R₁₆ ist, worin A eine ggf. durch eine C₁-C₆-Alkylgruppe substituierte Alkylengruppe mit 1-4 C-Atomen, insbesondere mit 1 C-Atom, eine Carbonylgruppe, ein Sauerstoffatom oder die Gruppe -SO_x- mit X = 0, 1 oder 2 ist, R₁₄ und R₁₅ jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom oder eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen sind und R₁₆ eine gerade oder verzweigte Alkylkette mit 1-10 C-Atomen, eine Cycloalkylgruppe mit 3-10 C-Atomen, eine Cycloalkylalkylgruppe mit 7-20 C-Atomen, eine Aralkylgruppe mit 7-20 C-Atomen, wobei der Arylrest ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituiert sein kann, eine ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierte Phenylgruppe oder ein ggf. durch Alkylgruppen oder Halogenatome substituierter heterocyclischer Ring ist,

R₂ eine Gruppe -CH(R₂₁)R₂₂, wobei R₂₁ ein Wasserstoffatom, eine C₁-C₁₀-Alkylgruppe oder ein ggf. substituierter Phenylring und R₂₂ ein ggf. substituierter Phenylring oder Naphthylring sind oder eine Gruppe -CH₂CH(R₂₃)R₂₄, mit R₂₃ und R₂₄ in der Bedeutung eines ggf. substituierten Phenylringes ist,

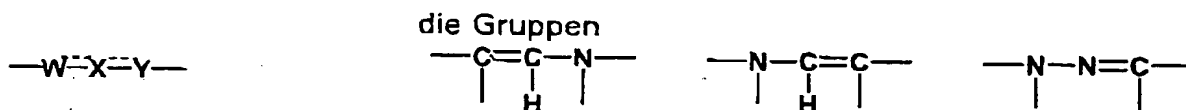
R₃ und R₄ jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe mit 1-10 C-Atomen sind und R₃ auch ein Halogenatom sein kann,

R₅ eine über den Rest Z verknüpfte Gruppe ist,



worin G -C=C-, -C=N-, -N=C-, ein Sauerstoff- oder Schwefelatom ist, Z eine Direktbindung, ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom, die Gruppe CH-R₅₂ oder -CH-R₅₃-

, wobei R52 und R53 unabhängig von einander die Bedeutung eines Wasserstoffatoms oder einer Alkylgruppe und n der Zahlen 1 und 2 haben, eine $-C\equiv C-$ -Dreifachbindung oder eine E- oder Z-konfigurierte Gruppe $-CR_{52}=CR_{53}-$ oder $C=CR_{52}R_{53}$ ist, wobei R52 und R53 unabhängig von einander die Bedeutung eines Wasserstoffatoms oder einer Alkylgruppe haben, L eine CH_2- oder eine $NH-$ -Gruppe ist, Q eine Carbonyl- oder $-SO_x$ -Gruppe mit $X = 0, 1$ oder 2 ist und R51 eine ggf. durch eine Alkylgruppe substituierte Amino- oder eine gerade oder verzweigte, ggf. durch Halogenatome, Hydroxyl- oder Alkoxygruppen substituierte Alkylgruppe oder eine ggf. durch Halogenatome, Hydroxyl- oder Alkoxygruppen substituierte Cycloalkylgruppe mit 3-7 Ringgliedern ist, R6 die Gruppe $CH_2-N(R_{61})R_{62}$ ist, wobei R61 jeweils unabhängig ein Wasserstoffatom oder eine Alkylgruppe und R62 eine Alkylgruppe oder eine ggf. substituierte Aralkylgruppe oder Heteroarylalkylgruppe mit 7-20 C-Atomen sind und



in jeder Orientierung bedeuten kann, ferner alle Stereoisomeren der genannten Strukturen sowie Salze derselben mit physiologisch verträglichen Säuren oder Basen.

2. Verbindungen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet,

dass $W-X-Y$ die Gruppe $\begin{array}{c} N-C-C \\ | \quad | \\ H \quad \quad | \end{array}$ oder $\begin{array}{c} C-N-N \\ | \quad | \end{array}$ ist.

- 38 -

3. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2,
dadurch gekennzeichnet,
dass R1 die Gruppe -CO-R11 ist.

5 4. Verbindungen nach Anspruch 3,
dadurch gekennzeichnet,
dass R11 aus Methyl, Ethyl, i-Propyl, Phenyl, 2-Thienyl und 2-Furyl
ausgewählt ist.

10 5. Verbindungen nach Anspruch 1 oder 2,
dadurch gekennzeichnet,
dass R1 die Gruppe -CO-OR12 ist.

15 6. Verbindungen nach Anspruch 5,
dadurch gekennzeichnet,
dass R12 aus Methyl, Ethyl oder i-Propyl ausgewählt ist.

20 7. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 6,
dadurch gekennzeichnet,
dass R2 eine 2',5'-Difluorbenzylgruppe ist.

25 8. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 7,
dadurch gekennzeichnet,
dass R3 und R4 Wasserstoffatome sind.

9. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 8,
dadurch gekennzeichnet,
dass Z eine direkte Bindung oder ein Sauerstoffatom ist.

30 10. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 9,
dadurch gekennzeichnet,
dass G - C = C - bedeutet.

- 39 -

11. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 10,
dadurch gekennzeichnet,
dass L eine NH-Gruppe ist.

5 12. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 11,
dadurch gekennzeichnet,
dass Q eine Carbonylgruppe ist und R₅₁ eine C₁-C₆-Alkylgruppe ist.

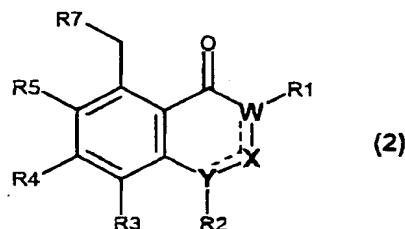
10 13. Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 12,
dadurch gekennzeichnet,
dass R₆₁ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe ist oder/und
R₆₂ eine Benzylgruppe ist.

15 14. Verwendung von Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 13
als Antagonisten des Gonadotropin-freisetzenden Hormons (GnRH).

20 15. Verwendung nach Anspruch 14 zur männlichen Fertilitätskontrolle,
zur Hormontherapie, zur Behandlung weiblicher Sub- und Infertilität,
zur weiblichen Empfängnisverhütung und zur Tumorbekämpfung.

16. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel
(1) durch

(a) Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (2)

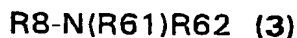


25

- 40 -

wobei R7 eine Abgangsgruppe bedeutet und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (3)

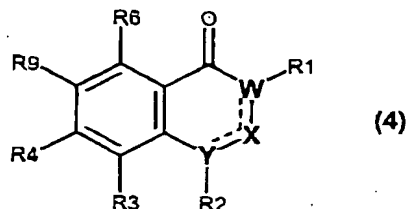
5



wobei R8 ein Wasserstoffatom oder ein Metallatom bedeutet und R61 und R62 die bei Verbindung (1) angegebenen Bedeutungen haben,

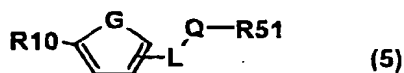
10

(b) Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (4)



worin R9 die Gruppe $-OSO_2C_nF_{2n+1}$, ein Halogenatom, besonders ein Brom- oder Jodatom oder eine andere Abgangsgruppe ist und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (5)

15



20

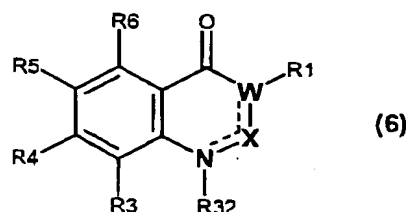
wobei R10 eine ein Metall oder ein Nichtmetall enthaltende Gruppe, eine ggf. in ein Metallsalz überführte Hydroxy- oder Mercapto-Gruppe, die Gruppe $-C\equiv C-R31$ oder eine E- oder Z-konfigurierte Gruppe $-CR52=CR53R31$ oder $-CR31=CR52R53$ ist, worin R31 eine ein Metall oder ein

25

- 41 -

Nichtmetall enthaltende Grupp ist und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit oder ohne Mitwirkung eines Katalysators;

- (c) wenn Y in Verbindung (1) ein Stickstoffatom ist, durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (6)

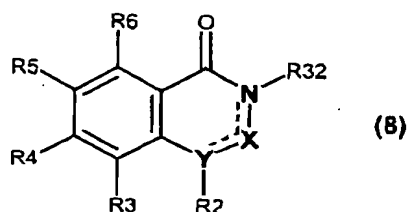


wobei R32 ein Wasserstoffatom oder ein Metallatom bedeutet und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (7).

R33-R2 (7)

wobei R33 eine Abgangsgruppe bedeutet und R2 die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung hat, oder

- (d) wenn W in Verbindung (1) ein Stickstoffatom ist, durch Umsetzung einer Verbindung der allgemeinen Formel (8)



- 42 -

wobei R32 ein Wasserstoffatom oder ein Metallatom bedeutet und alle anderen Reste die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel (9)

5

R33-R1 (9)

wobei R33 eine Abgangsgruppe bedeutet und R1 die bei Verbindung (1) angegebene Bedeutung hat.

20020215 14:56